

500,604

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
24. Juli 2003 (24.07.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 03/059905 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 401/14,  
401/12, 409/14, 405/14, 207/26, 403/12, C07C 211/54,  
211/56, A61K 31/4015, 31/403, 31/4025, A61P 3/04, 3/10

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/CH02/00725

(22) Internationales Anmeldedatum:  
27. Dezember 2002 (27.12.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
2381/01 31. Dezember 2001 (31.12.2001) CH  
PCT/CH02/00429 5. August 2002 (05.08.2002) CH

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): AXOVAN LTD. [CH/CH]; Gewerbestrasse 16,  
CH-4123 Allschwil (CH).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ISLER, Markus  
[CH/CH]; In den Dürrenmatten 2, CH-4123 Allschwil  
(CH). GILLER, Thomas [CH/CH]; Hauptstrasse 236,  
CH-4451 Wintersingen (CH). SCHWALM, Günter  
[DE/CH]; Schafmattweg 34, CH-4102 Binningen (CH).  
STEGE, Matthias [CH/CH]; Engweg 3, CH-8006  
Zürich (CH). HILPERT, Kurt [CH/CH]; Eichenstrasse  
5, CH-4114 Hofstetten (CH). VALDENNAIRE, Oliver  
[FR/CH]; Ochsenegasse 18, CH-4123 Allschwil (CH).  
BREU, Volker [DE/DE]; Leonhard-Müller-Strasse 9A,  
79418 Schliengen (DE).

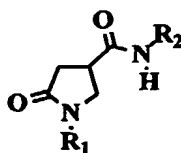
(74) Anwalt: BRAUN, André; Braun & Partner, Reussstrasse  
22, CH-4054 Basel (CH).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT  
(Gebrauchsmuster), AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY,  
BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ (Gebrauchsmuster),  
CZ, DE (Gebrauchsmuster), DE, DK (Gebrauchsmuster),  
DK, DM, DZ, EC, EE (Gebrauchsmuster), EE, ES, FI (Ge-  
brauchsmuster), FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID,

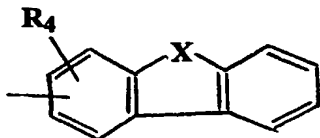
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: PYRROLIDONE CARBOXAMIDES

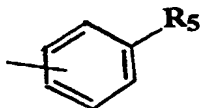
(54) Bezeichnung: PYRROLIDON-CARBOXAMIDE



(I)



(a)



(b)

(57) Abstract: Pyrrolidone carboxamides of formula (I) where R<sup>2</sup> = a group of formula (a) or (b), R<sup>5</sup> = phenyl, heteroalkyl, aryloxy, alkoxy, alkanoyl or -NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> and R<sup>1</sup>, X, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>6</sup> and R<sup>7</sup> have the meanings given in the description and the claims, pharmaceutically applicable acid addition salts with basic compounds of formula (I), pharmaceutically applicable salts of acid compounds of formula (I) with bases, pharmaceutically applicable esters of hydroxy- or carboxy-group containing compounds of formula (I) and hydrates and solvates thereof, inhibit the interaction of neuropeptide Y (NPY) with one of the neuropeptide receptor subtypes (NPY-Y5) and are particularly suitable for the prevention and treatment of arthritis, diabetes and especially eating disorders and obesity. The above can be produced by known methods and converted into a galenic dosage form.

(57) Zusammenfassung: Pyrrolidoncarboxamide der Formel (I) worin R<sup>2</sup> einen Rest der Formel (a) oder (b) bedeutet, R<sup>5</sup> Phenyl, Heteroalkyl, Aryloxy, Alkoxy, Alkanoyl oder -NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> bedeutet und R<sup>1</sup>, X, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> die in der Beschreibung und den Ansprüchen definierte Bedeutung besitzen, pharmazeutisch verwendbare Säureadditionssalze von basischen Verbindungen der Formel (I), pharmazeutisch verwendbare Salze von sauren Verbindungen der Formel (I) mit Basen, pharmazeutisch verwendbare Ester von Hydroxy- oder Carboxygruppen enthaltenden Verbindungen der Formel (I) sowie Hydrate oder Solvate davon, hemmen die Interaktion des Neuropeptids Y (NPY) mit einem der Neuropeptid-Rezeptor-Subtypen (NPY-Y5)

und eignen sich insbesondere für die Vorbeugung und Behandlung von Arthritis, Diabetes und speziell von Essstörungen und Obesitas. Sie können nach an sich bekannten Methoden hergestellt und in galenische Darreichungsformen gebracht werden.

WO 03/059905 A1